

3/5/3

DIALOG(R) File 352:Derwent WPI
(c) 2005 Thomson Derwent. All rts. reserv.

007786874

WPI Acc No: 1989-051986/198907

XRAM Acc No: C89-023225

Dermatitis treatment agent - comprises acetyl salicylic acid, its derivs. and/or their salts

Patent Assignee: GREEN CROSS CORP (GREC)

Number of Countries: 001 Number of Patents: 001

Patent Family:

Patent No	Kind	Date	Applicat No	Kind	Date	Week
JP 64003123	A	19890106	JP 87156415	A	19870625	198907 B

Priority Applications (No Type Date) : JP 87156415 A 19870625

Patent Details:

Patent No	Kind	Lan Pg	Main IPC	Filing Notes
JP 64003123	A	3		

Abstract (Basic) : JP 64003123 A

Agent comprises acetyl salicylic acid, its derivs. and/or their physiologically allowed salts.

Acetyl salicylic acid or its derived salts are salts combined with basic amino acid (e.g. arginine, lysine), pref. lysine salt of acetyl salicylic acid-DL-lysine salt.

USE/ADVANTAGE - The agent has good treatment effect for dermatitis, esp. for ambusion.

0/0

Title Terms: DERMATITIS; TREAT; AGENT; COMPRISE; ACETYL; SALICYLIC; ACID; DERIVATIVE; SALT

Derwent Class: B05

International Patent Class (Additional) : A61K-031/60

File Segment: CPI

⑨ 日本国特許庁 (JP)

⑪ 特許出願公開

⑫ 公開特許公報 (A)

昭64-3123

⑥Int.Cl.¹

A 61 K 31/60

識別記号

A B E
A D A

庁内整理番号

7375-4C

⑩公開 昭和64年(1989)1月6日

審査請求 未請求 発明の数 1 (全3頁)

⑪発明の名称 皮膚炎症治療剤

⑫特願 昭62-156415

⑬出願 昭62(1987)6月25日

⑭発明者 平光忠久 静岡県浜松市蜆塚2丁目17-32 蜆塚ハイムB103

⑮出願人 株式会社 ミドリ十字 大阪府大阪市東区今橋1丁目15番地の1

⑯代理人 弁理士 佐々木清隆 外3名

明細書

1. 発明の名称

皮膚炎症治療剤

2. 特許請求の範囲

アセチルサリチル酸、その誘導体およびそれらの生理学的に許容される塩から選ばれる少なくとも一種を有効成分とする皮膚炎症治療剤。

3. 発明の詳細な説明

イ. 産業上の利用分野

本発明は、アセチルサリチル酸系化合物の新しい用途に関する。詳細には、アセチルサリチル酸、その誘導体およびそれらの生理学的に許容される塩から選ばれる少なくとも一種を有効成分とする皮膚炎症治療剤に関する。

ロ. 従来技術

酸やアルカリなどの化学薬品による熱傷は、皮膚に付着した薬品を出来るだけ早く除去することが必要であるが、熱傷による炎症を早期に抑制することが疼痛などの症状を軽減し、更に傷痕を残さない為にも肝要である。治療としては一般的の熱

傷の治療に準じて行われ、これまでワセリンガーゼ、ソフラテュール、豚皮などが用いられているが、特に劇的な治療法はないようである。

ハ. 発明が解決しようとする問題点

そこで、本発明者らは、上記の目的を解決するために種々研究を重ねた結果、アセチルサリチル酸、その誘導体およびそれらの生理学的に許容される塩が皮膚炎症、特に熱傷の治療に有効なことを見出して本発明を完成した。

ニ. 問題点を解決するための手段

本発明にて使用されるアセチルサリチル酸又はその誘導体の塩としては、有機塩基塩、アルカリ金属塩（ナトリウム塩、カリウム塩等）、アルカリ土類金属塩（カルシウム塩等）が例示される。とりわけ塩基性アミノ酸（たとえば、アルギニン、リジン）との塩が好ましい。特に好ましくは、アセチルサリチル酸のリジン塩（特に、アセチルサリチル酸-DL-リジン塩）である。かかる塩は、水溶性を有する。

なお、アセチルサリチル酸-DL-リジン塩の

特開昭64-3123(2)

製造法としては、特開昭56-10110の明細書にその記載がある。

本発明の薬剤は、通常、静注剤として投与されるものであるが、皮膚炎症に対しては経皮投与特に水溶液として患部への湿布が望ましい投与方法と考えられる。その用法としては、本発明薬剤の1~10W/V% (好みくは2~5W/V%) 溶液を、1回30分~2時間、1日1~数回の投与が例示される。

ホ.効果

本発明の薬剤は、後記臨床例で明らかなように、皮膚炎症、特に熱傷に対して優れた治療効果を有する。

ヘ.臨床例

本発明により詳細に説明するため臨床例を挙げるが、本発明の適用はこの症例に限定されるものではない。

症例

52才の男性。62年2月3日午前8時頃、無水クロム酸 (CRO 1ℓ/200kg) を他の容

器に移し換えている作業中、両眼に溶液が飛入した。それで清浄水で洗眼しようとしたが、蛇口を間違えて2%硫酸液で両眼とその周囲を洗った。その後眼瞼を中心に顔面の発赤、腫脹が生じた為、洗眼等の応急処置を受けたが依然、顔面の発赤、腫脹と疼痛が著明であった。

初診時所見：視力、眼底には異常はなく、角膜も正常であった。両眼の球結膜と眼瞼結膜には軽度の充血と浮腫が認められた。眼瞼と鼻根部の皮膚を中心として著明な紅斑と浮腫が見られ、頬部と前額部の皮膚にも及んでおり、化学薬品による熱傷の所見を呈していた。患者は熱傷部位の熱感とひりひりとした痛みを訴えていた。

治療

アスピリン静注剤 (アスピリンDL-リジン、ヴェノビリン®実施例参照) の1バイアル900mgを20mℓの蒸留水に溶解して4%溶解液を作成して、これにガーゼを浸して、熱傷を受けた顔面に湿布した。湿布後の数分後には疼痛と熱感の軽減を自覚した。30分後には紅斑と腫脹も軽減

3

し始め、90分後には著明な紅斑は軽減し、軽度の紅斑は消失した。疼痛も苦痛ではない程度にまでに軽減した。この間、湿布を途中で1度、新たにアスピリン溶解液に浸したものに換えた。この日はトリアムシンロンアセトニド含有クリーム (ケナコルトクリーム) を処方して帰宅させた。

2日目には、初診時のような紅斑と腫脹の範囲と程度は著明に軽減していたが、前日のアスピリン湿布の治療後よりは残存していた紅斑と腫脹がやや増大していた。

一部は痂皮の形成が認められた。疼痛はほとんどなくなっていた。残存した発赤と腫脹に対して前日と同様のアスピリン溶液の湿布の治療をおこなった。60分間の湿布により紅斑と腫脹が軽減したのが認められた。3日目にも残存した紅斑に湿布を行った。4日目には紅斑は消退して、痂皮を形成し落屑化していた。この日も湿布をおこなった。その後トリアムシンロンアセトニド含有軟膏 (ケナコルトA軟膏) を日に2回塗布していたが、10日目には傷痕を残すことなくほぼ完全に

4

治癒した。

実験例：毒性

実験動物として体重20±1gのdd系マウスの雌雄 (週令4~5) を用いた。後記実施例に示した製剤を蒸留水で各種濃度に溶解し、静脈内、皮下および経口の経路より投与した。各投与群とも雌雄各々10匹を使用した。

薬剤投与後7日間まで、その毒性症状および死亡状況を観察し、観察期間中に死亡した動物および投与後7日間まで生存した動物についても全例剖検を行い、肉眼的に異常の有無を観察した。マウスのLD₅₀値についてまとめ表1に示す。

表1

投与経路	性	LD ₅₀ (mg/kg)
静脈	♂	1070
	♀	950
皮下	♂	1840
	♀	2100
経口	♂	3500
	♀	3270

特開昭64-3123(3)

実施例

アセチルサリチル酸 - 900 mg
D L - リジン塩
着色防止剤 アミノ酢酸 100 mg
(日本薬局方)
安定剤 塩化カルシウム 50 mg
(無水物) _____

計 1.050 mg

有効成分のアセチルサリチル酸 - D L - リジン
塩 900 mg は、アセチルサリチル酸 498 mg と D
L - リジン 402 mg とからなる塩である。

本製剤は使用に際しては、注射用蒸留水によっ
て 4% 溶液に調整して局所投与剤（湿布用液剤）
とされる。

代理人弁理士 (8107) 佐々木 清隆
(ほか 3名)

